

Bejelentés ügyszám: P9006007 Bejelentés napja: 19900921  
 Adatközlés napja: 19910328  
 Közzétételi szám: 55002 Közzététel napja: 19910429  
 Lajstromszám: 207853 Megadás napja: 19930217  
 Megadás meghirdetése: 19930628  
 Elsőbbségi adatok: DEP3931432 - 19890921  
 NSZO: C07D-239/28; C07D-401/06; C07D-403/06; C07D-413/06; C07D-417/06;  
 A61K-031/505

**Magyar cím:**

Eljárás pirimidin-4,6-dikarbonsav-diamidok előállítására

**Angol cím:**

PROCESS FOR PRODUCING PYRIMIDINE-4,6-DICARBOXYLIC ACID-DIAMIDES

**Bejelentő:**

Hoechst Ag., Frankfurt/Main, DE

**Feltaláló:**

dr. Baader, Ekkehard, Königstein/Taunus, DE

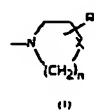
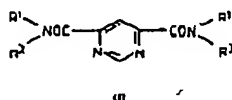
dr. Bickel, Martin, Bad Homburg, DE

dr. Günzler-Pukall, Volkmar, Marburg, DE

dr. Henke, Stephan, Hofheim/Taunus, DE

**Képviselő:**

Danubia Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest



**Kivonat:**

A találmány tárgya eljárás (I) általános képletű vegyületek és fiziológiailag alkalmas sóik előállítására, ahol

R1 jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, vagy 2-12 szénatomos alkinilcsoport, amelyek adott esetben szubsztituáltak lehetnek, vagy

R1 jelenthet még telített 5-7 szénatomos cikloalkil-csoportot, amely adott esetben benzolgyűrűhöz kapcsolódhat, vagy

R1 jelenthet továbbá adott esetben szubsztituált aril- vagy heteroarilcsoportot, vagy

R1 jelentése akkor amikor R2 hidrogénatomot jelent, aminocsoport is lehet, amely szubsztituátlan vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, fenilcsoporttal vagy 1-3 szénatomos alkil-karbonilcsoporttal mono- vagy diszubsztituált lehet, és

R2 jelentése hidrogénatom vagy megegyezik R1 jelentésével, ahol R2 és R1 jelentése azonos vagy különböző, vagy R1 és R2 együttesen a közébszárt nitrogénatommal együtt egy (1) általános képletű csoportot alkot, ahol

n értéke 1 és 3 közötti egész szám, és

X jelentése oxigénatom, kénatom, metilén-csoport vagy egy /N-R3 általános képletű csoport, és

R3 jelentése hidrogénatom vagy adott esetben helyettesített fenilcsoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, vagy 2-6 szénatomos alkinilcsoport, vagy

R3 jelentése egy -N(R4)2 általános képletű csoport, ahol R4 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport, vagy

R3 jelenthet még egy COOR5 általános képletű csoportot, ahol R5 jelentése hidrogénatom, vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport, vagy jelenthet egy -CON(R6)2 általános képletű csoportot, ahol

R6 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport vagy (R6)2 jelentése egy 4-6 szénatomos alkilénlánc, amelyben egy a nitrogénatommal nem közvetlenül szomszédos -CH2-csoport helyett egy oxigénatom, kénatom vagy egy /N-R4-csoport állhat, vagy

R3 jelenthet még egy 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoportot vagy 3-7 szénatomos cikloalkilcsoportot.

A vegyületek a prolin- és lizin-hidroxiláz inhibitorai és fibrozsuppresszívaként és immunsuppresszívaként használhatók.

1. Eljárás (I) általános képletű vegyületek és fiziológiailag alkalmas sóik előállítására, ahol

R1 jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy fenilcsoporttal vagy egy vagy két hidroxilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos mono- vagy dialkil-amino-csoporttal, halogénatommal vagy 1-4 szénatomos alkil-karbonil-oxi-csoporttal helyettesítve lehet vagy

R1 jelentése fenilcsoport vagy aminocsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal mono- vagy diszubsztituált lehet,

R2 jelentése hidrogénatom, vagy

R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal egy (1) általános képletű csoportot alkot, ahol

n értéke 1 és 3 közötti egész szám,

X jelentése oxigénatom, kénatom, metilencsoport, vagy egy

NR3 általános képletű csoport, és

R3 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport -, azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű vegyületet - ahol

Y jelentése halogénatom, hidroxilcsoport vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoport, vagy a karbonilcsoporttal együtt egy aktív észtercsoportot vagy vegyes anhidridet alkot - egy (III) általános képletű vegyülettel, ahol R1 és R2 jelentése az (I) általános képletnél megadott, reagáltatunk, és kívánt esetben az R1 jelentésében 1-4 szénatomos alkoxi-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületet R1 jelentésében hidroxil-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületté hidrolizáljuk, és/vagy

kívánt esetben az R1 jelentésében hidroxil-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületet R1 jelentésében (1-4 szénatomos alkil-karbonil-oxi)-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületté acilezzük, és/vagy

kívánt esetben a kapott (I) általános képletű vegyületből fiziológiailag alkalmas sók képzünk.

2. Az 1. igénypont szerinti eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek és fiziológiailag alkalmas sóik előállítására - ahol

R1 jelentése 1-12 alkilcsoport, amely adott esetben egy fenilcsoporttal vagy egy vagy két hidroxilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos mono- vagy di-alkil-amino-csoporttal, halogénatommal vagy 1-4 szénatomos alkil-karbonil-oxi-csoporttal helyettesítve lehet, vagy

R1 jelentése fenilcsoport, vagy

R1 jelentése aminocsoport amely szubsztituálatlan vagy 1-3 szénatomos alkilcsoporttal helyettesítve van,

R2 jelentése hidrogénatom, vagy

R1 és R2 együttesen a közbezárt nitrogénatommal együtt egy (2) általános képletű csoportot alkot, ahol

X jelentése oxigénatom,

CH2-csoport, vagy egy N-R3 általános képletű

csoport, ahol

R3 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport -, azzal jellemezve, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

3. Az 1. igénypont szerinti eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek és fiziológiailag alkalmas sóik előállítására, ahol

R1 jelentése 1-12 alkilcsoport, amely adott esetben egy fenilcsoporttal vagy egy vagy két hidroxilcsoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicsoporttal, vagy di-(1-3 szénatomos alkil)-amino-csoporttal helyettesítve van, vagy

R1 jelentése fenilcsoport vagy aminocsoport,

R2 jelentése hidrogénatom, vagy

R1 és R2 együttesen a közbezárt nitrogénatommal együtt egy (2) általános képletű csoportot alkot, ahol

X jelentése oxigénatom, CH2-csoport, vagy egy

N-R3 általános képletű csoport, ahol

R3 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, azzal jellemezve, hogy  
megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk.